

[First Hit](#)[Previous Doc](#)[Next Doc](#)[Go to Doc#](#) [Generate Collection](#) [Print](#)

L9: Entry 88 of 115

File: DWPI

Jul 28, 1979

DERWENT-ACC-NO: 1979-65603B

DERWENT-WEEK: 200402

COPYRIGHT 2005 DERWENT INFORMATION LTD

TITLE: Ointment base contg. polyethylene oxide - for admin. to oral cavity, uterus, vagina, wounds etc.

PATENT-ASSIGNEE:

ASSIGNEE	CODE
NIPPON KAYAKU KK	NIPK

PRIORITY-DATA: 1978JP-0001118 (January 11, 1978)[Search Selected](#) [Search ALL](#) [Clear](#)**PATENT-FAMILY:**

PUB-NO	PUB-DATE	LANGUAGE	PAGES	MAIN-IPC
<input type="checkbox"/> JP 54095723 A	July 28, 1979		000	

INT-CL (IPC): A61K 9/06**ABSTRACTED-PUB-NO:** JP 54095723A**BASIC-ABSTRACT:**

Ointment base contains polyethylene oxide of mol. wt. of the order of 104 pref. 200-5000 x 103 in amt. of 1-60% to base wt.

Base may be applied to any moist region where the salt concn. may be high or low, e.g. body cavities such as the uterus, vagina, oral cavity, esophagus rectum, urethra or wounded parts of the skin. Ointment base is e.g. vaseline, polyethylene glycol or a mixt. of vegetable oil and honey wax.

Ointment has good adhesive properties, slow-release properties etc.

TITLE-TERMS: OINTMENT BASE CONTAIN POLYETHYLENE OXIDE ADMINISTER ORAL CAVITY UTERINE VAGINAL WOUND**DERWENT-CLASS:** A25 A96 B05 B07**CPI-CODES:** A05-H03; A12-V01; B04-C03C; B12-A01; B12-C05; B12-D01; B12-D07; B12-D08; B12-G07; B12-M02;**CHEMICAL-CODES:**

Chemical Indexing M1 *01*
Fragmentation Code

V800 V622 V624 V795 V621 V780 V743 H581 H583 H584
H589 M620 M430 M431 M510 M520 M530 M540 M782 R021
R035 M423 M902

Chemical Indexing M1 *02*

Fragmentation Code
V060 V120 V121 V122 V141 F113 F123 F130 F199 G563
L810 L819 H121 H122 H123 H162 H163 H182 H183 J451
J471 H401 H461 H481 H422 H423 H424 J521 J221 J222
H521 H523 M240 M232 M233 M331 M333 M430 M431 P220
M510 M523 M530 M540 M541 M782 R021 R035 M413 M902

Chemical Indexing M2 *03*

Fragmentation Code
K0 H1 J6 H4 J5 J2 H5 M126 M129 M141
M139 M149 M282 M283 M210 M231 M232 M240 M260 M270
M281 M311 M332 M331 M321 M342 M340 M370 M391 F123
F130 F199 L810 L819 H121 J451 J471 H422 H423 H424
J521 J221 J222 H521 H523 M430 M431 P220 M510 M523
M530 M540 M782 R021 R035 M413 M902

Chemical Indexing M2 *04*

Fragmentation Code
K0 H1 H4 H5 M126 M129 M141 M139 M149 M311
M332 M323 M280 M342 M340 M370 M393 F113 F123 F199
G563 L810 L819 H122 H123 H162 H163 H182 H183 H401
H461 H481 H422 H423 H424 H521 H523 M430 M431 P220
M510 M523 M530 M541 M782 R021 R035 M413 M902

Chemical Indexing M2 *05*

Fragmentation Code
K0 H1 J2 M283 M210 M231 M260 M270 M281 M313
M314 M332 M331 M321 M342 M380 M391 L721 L722 H181
J271 M620 M430 M431 M510 M520 M530 M540 M782 R021
R035 M416 M902

Chemical Indexing M2 *06*

Fragmentation Code
H1 H4 M210 M232 M270 M281 M312 M332 M331 M321
M343 M370 M391 G100 M531 H181 H401 H481 H442 H443
H444 M430 M431 M510 M520 M540 M782 R021 R035 M414
M902

Chemical Indexing M2 *07*

Fragmentation Code
K0 M313 M314 M315 M332 M334 M321 M280 M343 M344
M380 M391 K710 K799 M620 M430 M431 M510 M520 M530
M540 M782 R021 R035 M416 M902

Chemical Indexing M2 *08*

Fragmentation Code
J5 H6 M320 M280 F542 J522 H601 M430 M431 M510
M521 M530 M540 P631 P633 P634 M782 R021 R035 M413
M902

Chemical Indexing M6 *09*

Fragmentation Code
R021 R111 R052 R210 R280 R271 R272 R290 R001 P220
M902

Chemical Indexing M2 *09*

Fragmentation Code
F010 F011 F012 F013 F014 F015 F016 F017 F018 F019
F123 F130 F199 H1 H100 H101 H102 H103 H121 H4
H402 H403 H404 H422 H423 H424 H5 H521 H523 J011
J012 J013 J014 J2 J221 J222 J451 J471 J5 J521
J6 K0 L560 L640 L810 L811 L812 L813 L814 L815
L816 L817 L818 L819 L821 L822 L823 L824 L831 L832
L833 L834 L942 M126 M129 M139 M141 M149 M210 M231
M232 M240 M260 M270 M281 M282 M283 M311 M321 M331
M332 M340 M342 M370 M391 M413 M430 M431 M510 M523
M530 M540 M782 M903 P220 R021 R035

Chemical Indexing M2 *10*

Fragmentation Code
F010 F011 F012 F013 F014 F015 F016 F017 F018 F019
F113 F123 F199 G000 G003 G030 G033 G034 G035 G036
G037 G038 G039 G563 H1 H100 H101 H102 H103 H122
H123 H162 H163 H182 H183 H4 H401 H402 H403 H404
H422 H423 H424 H461 H481 H5 H521 H523 K0 L640
L810 L811 L812 L813 L814 L815 L816 L817 L818 L819
L821 L822 L823 L824 L831 L833 L834 M126 M129 M139
M141 M149 M280 M311 M323 M332 M340 M342 M370 M393
M413 M430 M431 M510 M523 M530 M541 M782 M903 P220
R021 R035

Chemical Indexing M2 *11*

Fragmentation Code
H1 H100 H101 H102 H103 H181 J011 J2 J271 K0
L721 L722 M210 M231 M260 M270 M281 M283 M313 M314
M321 M331 M332 M342 M380 M391 M416 M430 M431 M510
M520 M530 M540 M620 M782 M903 R021 R035

Chemical Indexing M2 *12*

Fragmentation Code
G000 G001 G010 G011 G012 G013 G014 G015 G016 G017
G018 G019 G100 H1 H100 H101 H102 H103 H181 H4
H401 H402 H403 H404 H442 H443 H444 H481 M210 M232
M270 M281 M312 M321 M331 M332 M343 M370 M391 M414
M430 M431 M510 M520 M531 M540 M782 M903 R021 R035

Chemical Indexing M2 *13*

Fragmentation Code
F000 F010 F011 F012 F013 F014 F015 F016 F017 F018
F542 H6 H601 H621 H622 H623 J5 J522 L910 L921
L930 L941 L960 M280 M320 M413 M430 M431 M510 M521
M530 M540 M782 M903 P631 P633 P634 R021 R035

POLYMER-MULTIPUNCH-CODES-AND-KEY-SERIALS:

Key Serials: 0013 0231 1279 1588 2585 2766

Multipunch Codes: 011 028 04- 147 198 336 525 575 583 589 645 688 720

[Previous Doc](#)[Next Doc](#)[Go to Doc#](#)

⑨日本国特許庁(JP)

⑩特許出願公開

⑪公開特許公報(A)

昭54-95723

⑫Int. Cl.²
A 61 K 9/06

識別記号 ⑬日本分類
30 C 52

⑭内整理番号 ⑮公開 昭和54年(1979)7月28日
7057-4C

発明の数 1
審査請求 未請求

(全4頁)

⑯湿润部位用軟膏基剤

⑰特 願 昭53-1118
⑱出 願 昭53(1978)1月11日
⑲發明者 吉田功一
草加市弁天町320-69
同 二宮宏

狹山市水野791-31

⑳發明者 寺田隆
東京都北区豊島2-15-1
㉑出願人 日本化薬株式会社
東京都千代田区丸の内一丁目2
番1号
㉒代理人 弁理士 竹田和彦

明細書

1. 発明の名称

湿润部位用軟膏基剤

2. 特許請求の範囲

軟膏基剤にポリエチレンオキサイドを添加することを特徴とする湿润部位用軟膏基剤。

3. 発明の詳細な説明

本発明は湿润部位用軟膏基剤に関するものである。

從来、口腔、直腸、膣、子宮などの体腔、皮膚の損傷部位のような湿润した部位に対する軟膏としては油脂性基剤にゼラチン、カルボキシメチルセルローズナトリウム、アラビアゴム、ベクチンなどの親水性高分子ガムを練合して湿润部位に対する付着性と適度の親和性を有した軟膏が製造されているが付着性が十分でない。又、ポリアクリル酸ナトリウムを使用した口腔製剤が公知(特開昭51-38412)であるが、このものは尿道や子宮などの塩濃度の高い部位では薬物の徐放性

や付着性などが十分でない。以上のように湿润部位用軟膏基剤として未だ満足すべきものは得られていない。

本発明者らは上述の欠点を除去した湿润部位用の新規軟膏基剤を見出すべく鋭意研究を重ねた結果、從来の軟膏基剤にポリエチレンオキサイド(以下「PEO」という。)の適量を添加するときは、先ずPEOが水分を吸収して局所に強力に付着し、ついで膨潤した後、長時間にわたって局所において製剤が徐々に溶解するにつれ、薬物が均一に溶出してくること、塩が存在していても薬剤の放出は影響されることを見出した。

本発明は以上の知見に基づいて完成されたものである。

すなわち本発明は、軟膏基剤にPEOを添加することを特徴とする湿润部位用軟膏基剤に関する。

本発明で使用されるPEOの分子量は1万以上であれば特に制限はないが、そのうちでも20万~500万のものが好ましく、その添加率は基剤重量に対して1~60%になるようになるのがよ

い。

本発明の軟膏基剤の適用部位としては塩濃度の高い部位のみならずその濃度の低い部位であつても優れた効果を示す。例えば、尿道、子宮、陰嚢、口腔、食道、直腸などの体腔、皮膚の損傷部などがあげられる。

本発明の軟膏基剤を製造する場合、基剤としてはワセリン、ポリエチレングリコール、植物油と蜜蠟の混合物、プラスチベース(Plastibase, Squibb社製)などが使用される。

又目的に応じて、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン高級アルコールエーテル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、グリセリルモノ脂肪酸エステル、などの非イオン界面活性剤、脱水ラノリン、コレステロール、スクワレン、セチルアルコールなどの添加剤が使用される。

本発明の軟膏基剤を製造するには、PEOを揮発しやすい溶媒に溶解し、その溶液又は、PEOの粉末(30メッシュを通過するもの)を好ましく

特開昭54-95723(2)

は30メッシュを通過するものがよい。)を前記の基剤に添加、練合すればよい。

以上のようにして得られる本発明の軟膏基剤に薬物を配合することにより、使用部位の環境に影響されない局所付着性、徐放性の良好な軟膏が得られる。

この場合の薬物としてはステロイドホルモン、消炎酵素、インシクリン、ガストリン、セクレチン、ニトログリセリン、エリスリトールテトラナイトレートのような硝酸エステル、インプロテレノール、メタコリンのような局所吸収を期待するもの、又、消炎ステロイド、ロイコマイシン、フラジオマイシンのような抗生素、殺菌剤、リゾチーム、デキストリナーゼなどの酵素、局麻剤、ブレオマイシンや5FUなどの抗腫瘍剤のような局所効果を期待するものなどがあげられる。

本発明の軟膏基剤を用いて製造した軟膏は湿润部位に対する付着性がよく、徐放性にもすぐれ、又、特に塩濃度の高い部位においてもその性能の低下がみられないなどのすぐれた特徴を有する。

以上でPEOの配合により、周囲の環境に影響されない、付着性のよい、徐放性の軟膏基剤が得られることについて述べたが以下に本発明で得られる軟膏基剤が優れた効果を有することを実験例により説明する。

実験例1 塩溶液中での溶出試験

I. 試料の調製

試料1 PEO(150メッシュ通過品)4.85g、パテントブルー3g、白色ワセリン4.85gを練合した本発明の軟膏(試料A)。

試料2 ポリアクリル酸ナトリウム(150メッシュ通過品)4.85g、パテントブルー3g、白色ワセリン4.85gを練合した軟膏(対照試料、特開昭51-58482)。

II. 試験方法

試験は、ジョン エイツチ、ウッド ラ(John H. Wood et al.)(J. P. S. 53, 877~881(1964))の方法に準じて行つた。

先ずサンプルを正確に秤量し、それを500mlのビーカーの壁面にスパーテルで約4cm²の広がり

になるように塗布する。次いで37°Cの0.9%塩化ナトリウム水溶液(生理的塩溶液)500mlをビーカーに入れ攪拌を開始する。攪拌速度は300r.p.m.になるようにし、適時1回に2.5mlずつサンプリングを行う。サンプリングの都度0.9%塩化ナトリウム水溶液を加え内容液は常時500mlになるようにする。

採取サンプルは適当な濃度に稀釈し、日立分光度計124で638μmで吸光度を測定し、予め測定した検量線から1ml当たりのパテントブルー含量を求め、それに稀釈倍数を乗じて溶出量を求める。

III. 試験結果

0.9%塩化ナトリウム水溶液中の時間と本発明の試料A及び対照試料に含まれるパテントブルーの溶出率との関係を図1に示す。

この図から明らかのように本発明の試料Aは実験開始30分後に約8%、2時間後でも28%の溶出率であるが、対照試料では実験開始30分後では約16%、2時間後では46%の溶出率であ

つた。

又、ビーカーに付着させた軟膏の外観を詳細に観察すると試料Aは実験中全体がビーカーに付着したままでバテントブルーの溶出を除いて変化はなかつたが、対照試料では実験開始30分後にはビーカー壁の付着面積全体の1/6程度剥離し、2時間後では1/3程度剥離した。

上記の如く、本発明の軟膏基剤は塩溶液中での徐放性及び付着性の点で従来の軟膏基剤に比し非常にすぐれている。

次に実施例により本発明を具体的に説明する。

実施例1

PEO(平均分子量約200万、250メッシュ通過品)50部及び流動パラフィン10部を十分混合後、更に白色ワセリン58部を少量ずつ加えて十分練合して軟膏基剤とする。

実施例2

PEO(平均分子量約100万、200メッシュ通過品)50部及びプラスチベース50W[®]69.9部とを十分練合して軟膏基剤とする。

実施例3

PEO(平均分子量約350万、50メッシュ通過品)50部をクロロホルム100部に溶解せしめ、この溶液にワセリン69.9部を加えて、十分均一に混和後、50°Cで練合し乍ら、減圧下でクロロホルムを完全に蒸発除去し、軟膏基剤とする。

実施例4

PEO(平均分子量約150万、50メッシュ通過品)50部をメチルアルコール150mlに加え、50°Cに加温し、攪拌し乍ら完全に溶解せしめ、均一な溶液とする。この溶液に、ゴマ油10部、ミツロウ28部を加え、十分に均一に練合し、減圧下でメチルアルコールを完全に蒸発除去し、軟膏基剤とする。

4. 図面の簡単な説明

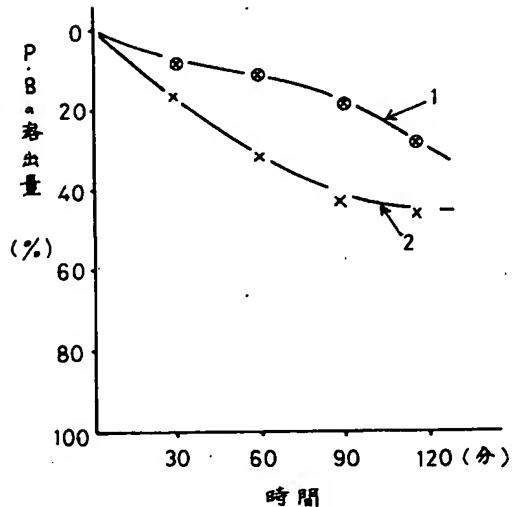
図1は0.9%塩化ナトリウム水溶液中での本発明の試料A及び対照試料中に含まれているバテントブルーの溶出率と時間との関係を示したものである。

1：本発明の試料A

2：対照試料

特許出願人 日本化薬株式会社

図1 図



手 担 補 正 書

昭和54年 1月23日

特許庁長官 鹿谷 勝二 殿

1. 事件の表示

昭和53年特許願第11118号

2. 発明の名称

混潤部位用軟膏基剤

3. 補正をする者

事件との関係 特許出願人

東京都千代田区丸の内一丁目2番1号

(408) 日本化薬株式会社

代表者 取締役社長 近藤 勝三

4. 代理人

東京都千代田区丸の内一丁目2番1号

日本化薬株式会社内

(6126) 弁理士 竹田 和彦

5. 補正命令の日付 (自 発)

6. 補正により増加する発明の数 なし

7. 補正の対象

明細書の発明の詳細な説明の欄

8. 補正の内容



9. 同、同ページ、下から10~9行目の「求め
る。」を「算出する。」に訂正する。

10. 同、同ページ、下から3行目の「30分後に」
を「30分後で」に訂正する。

11. 同、同ページ、末行の「では約16%、」を
「で約16%、」に訂正する。

12. 同、7ページ、3行目の「観察すると」を
「観察すると、」に訂正する。

13. 同、同ページ、9~10行目の「非常にすぐ
れている。」を「遙かにすぐれたものである。」
に訂正する。

14. 同、同ページ、下から7行目の「30部及び」
を「30部と」に訂正する。

15. 同、同ページ、下から6行目の「混合後、」
を「混合した後、」に訂正する。

16. 同、同ページ、下から6~5行目の「加えて」
を「加え、」に訂正する。

17. 同、同ページ、下から2行目の「30部及び」
を「30部と」に訂正する。

18. 同、同ページ、末行の「6.9.9部とを」を

特開昭54-95723.4)

補 正 の 内 容

- 明細書1ページ、下から5行目の「有した」
を「持たせた」に訂正する。
- 同、2ページ、下から9行目の「されないこ
とを」を「されないことなどを」に訂正する。
- 同、4ページ、下から6行目の「5FU」を
「5-FU」に訂正する。
- 同、5ページ、3行目の「述べたが」を
「述べたが、」に訂正する。
- 同、同ページ、下から5~3行目の「試験は、
……行つた。」を「試験は、ジョン・エイチ・
ウッドらの方法 [John H. Wood et al.: J. Pharm.
Sci. 53, 877~881 (1964)] に準じて行つた」
に訂正する。
- 同、6ページ、2行目の「生理的塩溶液」を
「生理食塩液」に訂正する。
- 同、同ページ、6行目の「加え内容液は」を
「加え、内容液が」に訂正する。
- 同、同ページ、9行目の「124で638μm」
「124を用いて638nm」に訂正する。

「6.9.9部を」に訂正する。

19. 同、8ページ、4~5行目の「加えて、……
混合後、」を「加えて十分均一に混合した後、」
に訂正する。

20. 同、同ページ、6行目および下から7行目の
「蒸発除去し、」を「蒸発させて除去し、」に
訂正する。

21. 同、同ページ、下から4行目の「図1」を
「第1図」に訂正する。

22. 同、第1図、縦軸の「P・Bの溶出量」を
「溶出率」に訂正する。

以 上